

(12) NACH DEM VERTRAG ÜBER DIE INTERNATIONALE ZUSAMMENARBEIT AUF DEM GEBIET DES
PATENTWESENS (PCT) VERÖFFENTLICHTE INTERNATIONALE ANMELDUNG

(19) Weltorganisation für geistiges Eigentum
Internationales Büro



(43) Internationales Veröffentlichungsdatum
22. September 2005 (22.09.2005)

PCT

(10) Internationale Veröffentlichungsnummer
WO 2005/087772 A1

(51) Internationale Patentklassifikation⁷: **C07D 487/04**,
A01N 43/90 // (C07D 487/04, 249:00, 239:00)

(21) Internationales Aktenzeichen: PCT/EP2005/002426

(22) Internationales Anmeldedatum:
8. März 2005 (08.03.2005)

(25) Einreichungssprache: Deutsch

(26) Veröffentlichungssprache: Deutsch

(30) Angaben zur Priorität:
102004012018.8 10. März 2004 (10.03.2004) DE

(71) Anmelder (für alle Bestimmungsstaaten mit Ausnahme
von US): **BASF Aktiengesellschaft** [DE/DE]; 67056
Ludwigshafen (DE).

(72) Erfinder; und

(75) Erfinder/Anmelder (nur für US): **TORMO I BLASCO**,
Jordi [ES/DE]; Carl-Benz-Str.10-3, 69514 Laudendach
(DE). **BLETTNER, Carsten** [DE/DE]; Richard-Wag-
ner-Str.48, 68165 Mannheim (DE). **MÜLLER, Bernd**
[DE/DE]; Stockinger Str. 7, 67227 Frankenthal (DE).
GEWEHR, Markus [DE/DE]; Goethestr. 21, 56288
Kastellaun (DE). **GRAMMENOS, Wassilios** [GR/DE];
Alexander-Fleming-Str. 13, 67071 Ludwigshafen (DE).
GROTE, Thomas [DE/DE]; Im Höhnhausen 18, 67157
Wachenheim (DE). **RHEINHEIMER, Joachim** [DE/DE];
Merziger Str.24, 67063 Ludwigshafen (DE). **SCHÄFER**,
Peter [DE/DE]; Römerstr.1, 67308 Ottersheim (DE).
SCHIEWECK, Frank [DE/DE]; Lindenweg 4, 67258
Hessheim (DE). **SCHWÖGLER, Anja** [DE/DE]; Hein-
rich-Lanz-Str. 3, 68165 Mannheim (DE). **WAGNER**,
Oliver [DE/DE]; Im Meisental 50, 67433 Neustadt (DE).

NIEDENBRÜCK, Matthias [DE/DE]; Albert-Ein-
stein-Allee 3, 67117 Limburgerhof (DE). **SCHERER**,
Maria [DE/DE]; Hermann-Jürgens-Str.30, 76829 Go-
dramstein (DE). **STRATHMANN, Siegfried** [DE/DE];
Donnersbergstr.9, 67117 Limburgerhof (DE). **SCHÖFL**,
Ulrich [DE/DE]; Erlenstr. 8, 68782 Brühl (DE). **STIERL**,
Reinhard [DE/DE]; Jahnstr.8, 67251 Freinsheim (DE).

(74) Gemeinsamer Vertreter: **BASF Aktiengesellschaft**;
67056 Ludwigshafen (DE).

(81) Bestimmungsstaaten (soweit nicht anders angegeben, für
jede verfügbare nationale Schutzrechtsart): AE, AG, AL,
AM, AT, AU, AZ, BA, BB, BG, BR, BW, BY, BZ, CA, CH,
CN, CO, CR, CU, CZ, DE, DK, DM, DZ, EC, EE, EG, ES,
FI, GB, GD, GE, GH, GM, HR, HU, ID, IL, IN, IS, JP, KE,
KG, KP, KR, KZ, LC, LK, LR, LS, LT, LU, LV, MA, MD,
MG, MK, MN, MW, MX, MZ, NA, NI, NO, NZ, OM, PG,
PH, PL, PT, RO, RU, SC, SD, SE, SG, SK, SL, SM, SY, TJ,
TM, TN, TR, TT, TZ, UA, UG, US, UZ, VC, VN, YU, ZA,
ZM, ZW.

(84) Bestimmungsstaaten (soweit nicht anders angegeben, für
jede verfügbare regionale Schutzrechtsart): ARIPO (BW,
GH, GM, KE, LS, MW, MZ, NA, SD, SL, SZ, TZ, UG,
ZM, ZW), eurasisches (AM, AZ, BY, KG, KZ, MD, RU,
TJ, TM), europäisches (AT, BE, BG, CH, CY, CZ, DE, DK,
EE, ES, FI, FR, GB, GR, HU, IE, IS, IT, LT, LU, MC, NL,
PL, PT, RO, SE, SI, SK, TR), OAPI (BF, BJ, CF, CG, CI,
CM, GA, GN, GQ, GW, ML, MR, NE, SN, TD, TG).

Veröffentlicht:

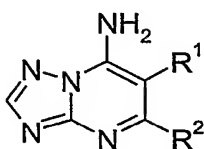
— mit internationalem Recherchenbericht

Zur Erklärung der Zweibuchstaben-Codes und der anderen Ab-
kürzungen wird auf die Erklärungen ("Guidance Notes on Co-
des and Abbreviations") am Anfang jeder regulären Ausgabe der
PCT-Gazette verwiesen.

(54) Title: 5,6-DIALKYL-7-AMINO-TRIAZOLOPYRIMIDINES, METHOD FOR THEIR PRODUCTION, THEIR USE FOR
CONTROLLING PATHOGENIC FUNGI AND AGENTS CONTAINING SAID COMPOUNDS

(54) Bezeichnung: 5,6-DIALKYL-7-AMINO-TRIAZOLOPYRIMIDINE, VERFAHREN ZU IHRER HERSTELLUNG UND
IHRE VERWENDUNG ZUR BEKÄMPFUNG VON SCHADPILZEN SOWIE SIE ENTHALTENDE MITTEL

(I)



(57) Abstract: The invention relates to 5,6-dialkyl-7-amino-triazolopyrimidines of formula
(I), in which the substituents are defined as follows: R¹ represents alkyl, alkoxyethylene or
alkoxyethylene, whereby the aliphatic groups can be substituted according to the description
and R² represents n-propyl or n-butyl. The invention also relates to a method for producing
said compounds, to agents containing the latter and to their use for controlling plant-patho-
genic fungi.

(57) Zusammenfassung: 5,6-Dialkyl-7-amino-triazolopyrimidine der Formel I in der die Sub-
stituenten folgende Bedeutung haben: R¹ Alkyl, Alkoxymethylen oder Alkoxyethylen, wobei
die aliphatischen Gruppen gemäß der Beschreibung substituiert sein können; R² n-Propyl oder n-Butyl; Verfahren zur Herstellung
dieser Verbindungen, sie enthaltende Mittel sowie ihre Verwendung zur Bekämpfung von pflanzenpathogenen Schadpilzen.



WO 2005/087772 A1

PATENT COOPERATION TREATY

PCT

INTERNATIONALER RECHERCHENBERICHT

(Artikel 18 sowie Regeln 43 und 44 PCT)

Aktenzeichen des Anmelders oder Anwalts 0000055414	<table style="width: 100%;"> <tr> <td style="width: 50%; text-align: center;"> WEITERES VORGEHEN </td> <td style="width: 50%; text-align: center;"> siehe Formblatt PCT/ISA/220 sowie, soweit zutreffend, nachstehender Punkt 5 </td> </tr> </table>	WEITERES VORGEHEN	siehe Formblatt PCT/ISA/220 sowie, soweit zutreffend, nachstehender Punkt 5
WEITERES VORGEHEN	siehe Formblatt PCT/ISA/220 sowie, soweit zutreffend, nachstehender Punkt 5		
Internationales Aktenzeichen PCT/EP2005/002426	<table style="width: 100%;"> <tr> <td style="width: 50%;"> Internationales Anmeldedatum (Tag/Monat/Jahr) 08/03/2005 </td> <td style="width: 50%;"> (Frühestes) Prioritätsdatum (Tag/Monat/Jahr) 10/03/2004 </td> </tr> </table>	Internationales Anmeldedatum (Tag/Monat/Jahr) 08/03/2005	(Frühestes) Prioritätsdatum (Tag/Monat/Jahr) 10/03/2004
Internationales Anmeldedatum (Tag/Monat/Jahr) 08/03/2005	(Frühestes) Prioritätsdatum (Tag/Monat/Jahr) 10/03/2004		
Anmelder BASF AKTIENGESELLSCHAFT			

Dieser internationale Recherchenbericht wurde von der Internationalen Recherchenbehörde erstellt und wird dem Anmelder gemäß Artikel 18 übermittelt. Eine Kopie wird dem Internationalen Büro übermittelt.

Dieser internationale Recherchenbericht umfaßt insgesamt 5 Blätter.

☒ Darüber hinaus liegt ihm jeweils eine Kopie der in diesem Bericht genannten Unterlagen zum Stand der Technik bei.

1. Grundlage des Berichts

a. Hinsichtlich der **Sprache** ist die internationale Recherche auf der Grundlage der internationalen Anmeldung in der Sprache durchgeführt worden, in der sie eingereicht wurde, sofern unter diesem Punkt nichts anderes angegeben ist.

☐ Die internationale Recherche ist auf der Grundlage einer bei der Behörde eingereichten Übersetzung der internationalen Anmeldung (Regel 23.1 b)) durchgeführt worden.

b. ☐ Hinsichtlich der in der internationalen Anmeldung offenbarten **Nucleotid- und/oder Aminosäuresequenz** siehe Feld Nr. 1.

2. ☐ Bestimmte Ansprüche haben sich als nicht recherchierbar erwiesen (siehe Feld II).

3. ☐ Mangelnde Einheitlichkeit der Erfindung (siehe Feld III).

4. Hinsichtlich der Bezeichnung der Erfindung

☒ wird der vom Anmelder eingereichte Wortlaut genehmigt.

☐ wurde der Wortlaut von der Behörde wie folgt festgesetzt:

5. Hinsichtlich der Zusammenfassung

☒ wird der vom Anmelder eingereichte Wortlaut genehmigt.

☐ wurde der Wortlaut nach Regel 38.2b) in der in Feld Nr. IV angegebenen Fassung von der Behörde festgesetzt. Der Anmelder kann der Behörde innerhalb eines Monats nach dem Datum der Absendung dieses internationalen Recherchenberichts eine Stellungnahme vorlegen.

6. Hinsichtlich der Zeichnungen

a. Ist folgende Abbildung der **Zeichnungen** mit der Zusammenfassung zu veröffentlichen: Abb. Nr. _____

☐ wie vom Anmelder vorgeschlagen

☐ wie von der Behörde ausgewählt, weil der Anmelder selbst keine Abbildung vorgeschlagen hat.

☐ wie von der Behörde ausgewählt, weil diese Abbildung die Erfindung besser kennzeichnet.

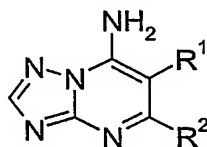
b. ☐ wird keine der Abbildungen mit der Zusammenfassung veröffentlicht.

5,6-Dialkyl-7-amino-triazolopyrimidine, Verfahren zu ihrer Herstellung und ihre Verwendung zur Bekämpfung von Schadpilzen sowie sie enthaltende Mittel

Beschreibung

5

Die vorliegende Erfindung betrifft 5,6-Dialkyl-7-amino-triazolopyrimidine der Formel I



in der die Substituenten folgende Bedeutung haben:

10 R¹ C₅-C₉-Alkyl, C₄-C₁₁-Alkoxymethylen oder C₃-C₁₀-Alkoxyethylen, wobei die aliphatischen Gruppen durch eine bis drei der folgenden Gruppen substituiert sein können:

15 Cyano, Nitro, Hydroxy, C₃-C₆-Cycloalkyl, C₁-C₆-Alkylthio, C₅-C₁₂-Alkynyl oder NR^aR^b;

R^a, R^b Wasserstoff oder C₁-C₆-Alkyl;

20 R² n-Propyl oder n-Butyl.

Außerdem betrifft die Erfindung Verfahren zur Herstellung dieser Verbindungen, sie enthaltende Mittel sowie ihre Verwendung zur Bekämpfung von pflanzenpathogenen Schadpilzen.

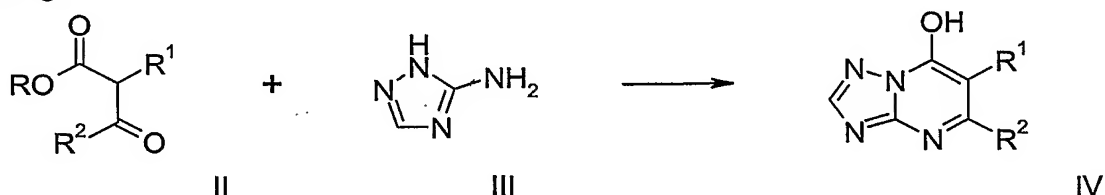
25 In GB 1 148 629 werden 5,6-Dialkyl-7-amino-triazolopyrimidine allgemein vorgeschlagen. Aus EP-A 141 317 sind einzelne fungizid wirksame 5,6-Dialkyl-7-amino-triazolopyrimidine bekannt. Ihre Wirkung ist jedoch in vielen Fällen nicht zufriedenstellend. Davon ausgehend, liegt der vorliegenden Erfindung die Aufgabe zugrunde, Verbindungen mit verbesserter Wirkung und/oder verbreitertem Wirkungsspektrum bereitzustellen.

30 Demgemäß wurden die eingangs definierten Verbindungen gefunden. Des weiteren wurden Verfahren und Zwischenprodukte zu ihrer Herstellung, sie enthaltende Mittel sowie Verfahren zur Bekämpfung von Schadpilzen unter Verwendung der Verbindungen I gefunden.

Die Verbindungen der Formel I unterscheiden sich von den aus den oben genannten Schriften durch die spezielle Ausgestaltung des Substituenten in der 5-Position des Triazolopyrimidin-Gerüsts.

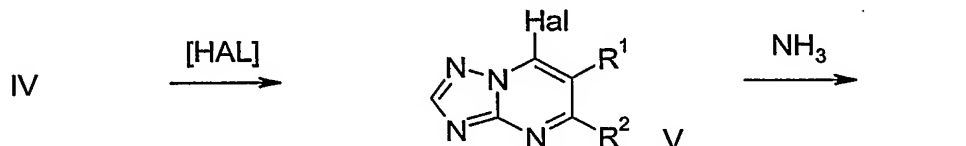
Die Verbindungen der Formel I weisen eine gegenüber den bekannten Verbindungen erhöhte Wirksamkeit gegen Schadpilze auf.

- 5 Die erfindungsgemäßen Verbindungen können auf verschiedenen Wegen erhalten werden. Vorteilhaft werden die erfindungsgemäßen Verbindungen erhalten, indem man substituierte β -Ketoestern der Formel II mit 3-Amino-1,2,4-triazol der Formel III zu 7-Hydroxytriazolopyrimidinen der Formel IV umsetzt. Die Gruppen R^1 und R^2 in Formeln II und IV haben die Bedeutungen wie für Formel I und die Gruppe R in Formel II bedeutet C_1 - C_4 -Alkyl, aus praktischen Gründen ist Methyl, Ethyl oder Propyl darin bevorzugt.



- Die Umsetzung der substituierten β -Ketoester der Formel II mit den Aminoazolen der Formel III kann in Gegenwart oder Abwesenheit von Lösungsmitteln durchgeführt werden. Vorteilhaft ist es, solche Lösungsmittel zu verwenden, gegenüber denen die Einsatzstoffe weitgehend inert sind und in denen sie ganz oder teilweise löslich sind. Als Lösungsmittel kommen insbesondere Alkohole wie Ethanol, Propanole, Butanole, Glykole oder Glykolmonoether, Diethylenglykole oder deren Monoether, aromatische Kohlenwasserstoffe, wie Toluol, Benzol oder Mesitylen, Amide wie Dimethylformamid, Diethylformamid, Dibutylformamid, N,N-Dimethylacetamid, niedere Alkansäuren wie Ameisensäure, Essigsäure, Propionsäure oder Basen, wie Alkalimetall- und Erdalkalimetallhydroxide, Alkalimetall- und Erdalkalimetalloxide, Alkalimetall- und Erdalkalimetallhydride, Alkalimetallamide, Alkalimetall- und Erdalkalimetallcarbonate sowie Alkalimetallhydrogencarbonate, metallorganische Verbindungen, insbesondere Alkalimetallalkyle, Alkylmagnesiumhalogenide sowie Alkalimetall- und Erdalkalimetallalkoholate und Dimethoxymagnesium, außerdem organische Basen, z.B. tertiäre Amine wie Trimethylamin, Triethylamin, Tri-isopropylethylamin, Tributylamin und N-Methylpiperidin, N-Methylmorpholin, Pyridin, substituierte Pyridine wie Collidin, Lutidin und 4-Dimethylaminopyridin sowie bicyclische Amine und Mischungen dieser Lösungsmittel mit Wasser in Frage. Als Katalysatoren kommen Basen wie voranstehend genannt, oder Säuren, wie Sulfonsäuren oder Mineralsäuren in Frage. Besonders bevorzugt wird die Umsetzung ohne Lösungsmittel oder in Chlorbenzol, Xylol, Dimethylsulfoxid, N-Methylpyrrolidon durchgeführt. Besonders bevorzugte Basen sind tertiäre Amine wie Triisopropylethylamin, Tributylamin, N-Methylmorpholin oder N-Methylpiperidin. Die Temperaturen liegen zwischen 50 und 300°C, vorzugsweise bei 50 bis 180°C, wenn in Lösung gearbeitet wird [vgl. EP-A 770 615; Adv. Het. Chem. Bd. 57, S. 81ff. (1993)].

Die Basen werden im allgemeinen in katalytischen Mengen eingesetzt, sie können aber auch äquimolar, im Überschuss oder gegebenenfalls als Lösungsmittel verwendet werden.



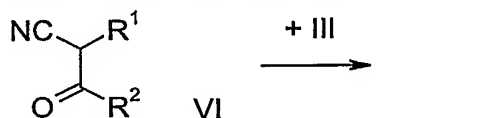
- 5 Die so erhaltenen Kondensationsprodukte der Formel IV fallen aus den Reaktionslösungen meist in reiner Form aus und werden nach dem Waschen mit dem gleichen Lösungsmittel oder mit Wasser und anschließendem Trocknen mit Halogenierungsmitteln, insbesondere Chlorierungs- oder Bromierungsmitteln zu den Verbindungen der Formel V, in der Hal für Chlor oder Brom, insbesondere für Chlor steht, umgesetzt.
- 10 Bevorzugt erfolgt die Umsetzung mit Chlorierungsmitteln, wie Phosphoroxychlorid, Thionylchlorid oder Sulfurylchlorid bei 50°C bis 150°C vorzugsweise in überschüssigem Phosphoroxitrichlorid bei Rückflußtemperatur. Nach dem Verdampfen des überschüssigen Phosphoroxitrichlorids wird der Rückstand mit Eiswasser gegebenenfalls unter Zusatz eines mit Wasser nicht mischbaren Lösungsmittels behandelt. Das aus der getrockneten organischen Phase gegebenenfalls nach Verdampfung des inerten Lösungsmittels isolierte Chlorierungsprodukt ist meist sehr rein und wird anschließend mit Ammoniak in inerten Lösungsmitteln bei 100°C bis 200°C zu den 7-Amino-triazolo[1,5-a]-pyrimidinen umgesetzt. Die Reaktion wird vorzugsweise mit 1- bis 10-molarem Überschuss an Ammoniak unter Druck von 1 bis 100 bar durchgeführt.

20

Die neuen 7-Amino-azolo[1,5-a]-pyrimidine werden gegebenenfalls nach Verdampfen des Lösungsmittels durch Digerieren in Wasser als kristalline Verbindungen isoliert.

- 25 Die β -Ketoester der Formel II können hergestellt werden wie in Organic Synthesis Coll. Vol. 1, S. 248 beschrieben, bzw. sind kommerziell erhältlich.

Alternativ können die neuen Verbindungen der Formel I erhalten werden, indem man substituierte Acylcyanide der Formel VI, in der R^1 und R^2 die oben angegebenen Bedeutungen haben, mit 3-Amino-1,2,4-triazol der Formel III umsetzt.



30

Die Umsetzung kann in Gegenwart oder Abwesenheit von Lösungsmitteln durchgeführt werden. Vorteilhaft ist es, solche Lösungsmittel zu verwenden, gegenüber denen die Einsatzstoffe weitgehend inert sind und in denen sie ganz oder teilweise löslich sind. Als Lösungsmittel kommen insbesondere Alkohole wie Ethanol, Propanole, Butanole, Glykole oder Glykolmonoether, Diethylenglykole oder deren Monoether, aromatische Kohlenwasserstoffe wie Toluol, Benzol oder Mesitylen, Amide wie Dimethylformamid, Diethylformamid, Dibutylformamid, N,N-Dimethylacetamid, niedere Alkansäuren wie

35

Ameisensäure, Essigsäure, Propionsäure oder Basen, wie voranstehend genannt, und Mischungen dieser Lösungsmittel mit Wasser in Frage. Die Umsetzungstemperaturen liegen zwischen 50 und 300°C, vorzugsweise bei 50 bis 150°C, wenn in Lösung gearbeitet wird.

5

Die neuen 7-Amino-triazolo[1,5-a]-pyrimidine werden gegebenenfalls nach Verdampfen des Lösungsmittels oder Verdünnen mit Wasser als kristalline Verbindungen isoliert.

10 Die für die Herstellung der 7-Amino-azolo[1,5-a]-pyrimidine benötigten substituierten Alkylcyanide der Formel VI sind teilweise bekannt oder können nach bekannten Methoden aus Alkylcyaniden und Carbonsäureestern mit starken Basen, z.B. Alkalihydriden, Alkalimetallalkoholaten, Alkaliamiden oder Metallalkylen, hergestellt werden (vgl.: J. Amer. Chem. Soc. Bd. 73, (1951) S. 3766).

15 Sofern einzelne Verbindungen I nicht auf den voranstehend beschriebenen Wegen zugänglich sind, können sie durch Derivatisierung anderer Verbindungen I hergestellt werden.

20 Sofern bei der Synthese Isomerengemische anfallen, ist im allgemeinen jedoch eine Trennung nicht unbedingt erforderlich, da sich die einzelnen Isomere teilweise während der Aufbereitung für die Anwendung oder bei der Anwendung (z.B. unter Licht-, Säure- oder Baseneinwirkung) ineinander umwandeln können. Entsprechende Umwandlungen können auch nach der Anwendung, beispielsweise bei der Behandlung von Pflanzen in der behandelten Pflanze oder im zu bekämpfenden Schadpilz erfolgen.

25

Bei den in den vorstehenden Formeln angegebenen Definitionen der Symbole wurden Sammelbegriffe verwendet, die allgemein repräsentativ für die folgenden Substituenten stehen:

30 Halogen: Fluor, Chlor, Brom und Jod;

Alkyl: gesättigte, geradkettige oder ein- oder zweifach verzweigte Kohlenwasserstoffreste mit 1 bis 4, oder 5 bis 9 Kohlenstoffatomen, z.B. C₁-C₆-Alkyl wie Methyl, Ethyl, Propyl, 1-Methylethyl, Butyl, 1-Methyl-propyl, 2-Methylpropyl, 1,1-Dimethylethyl, n-Pentyl, 1-Methylbutyl, 2-Methylbutyl, 3-Methylbutyl, 2,2-Di-methylpropyl, 1-Ethylpropyl, Hexyl, 1,1-Dimethylpropyl, 1,2-Dimethylpropyl, 1-Methylpentyl, 2-Methylpentyl, 3-Methylpentyl, 4-Methylpentyl, 1,1-Dimethylbutyl, 1,2-Dimethylbutyl, 1,3-Dimethylbutyl, 2,2-Dimethylbutyl, 2,3-Dimethylbutyl, 3,3-Dimethylbutyl, 1-Ethylbutyl, 2-Ethylbutyl, 1,1,2-Trimethylpropyl, 1,2,2-Trimethylpropyl, 1-Ethyl-1-methylpropyl und 1-Ethyl-2-methyl-
40 propyl;

Halogenmethyl: Methylgruppe, in der teilweise oder vollständig die Wasserstoffatome durch Halogenatome wie vorstehend genannt ersetzt sein können: insbesondere Chlormethyl, Brommethyl, Dichlormethyl, Trichlormethyl, Fluormethyl, Difluormethyl, Trifluormethyl, Chlorfluormethyl, Dichlorfluormethyl, Chlordifluormethyl;

5

Cycloalkyl: mono- oder bicyclische, gesättigte Kohlenwasserstoffgruppen mit 3 bis 6 Kohlenstoffringgliedern, wie Cyclopropyl, Cyclobutyl, Cyclopentyl und Cyclohexyl;

10

Alkoxymethylen und Alkoxyethylen: gesättigte, geradkettige oder ein-, zwei- oder dreifach verzweigte Kohlenwasserstoffkette, die über eine Methylenoxy-, bzw. Ethylenoxygruppe gebunden ist, z. B. Kohlenwasserstoffkette wie voranstehend beschrieben mit 3 bis 11 Kohlenstoffatomen, wie Propoxy-ethyl, Butoxy-ethyl, Pentoxy-ethyl, Hexyloxy-ethyl, Heptyloxy-ethyl, Octyloxy-ethyl, Nonyloxy-ethyl, 3-(3-Ethyl-hexyloxy)-ethyl, 3-(2,4,4-Trimethyl-pentyloxy)-ethyl, 3-(1-Ethyl-3-methyl-butoxy)-ethyl, Ethoxy-propyl, Propoxy-propyl, Butoxy-propyl, Pentoxy-propyl, Hexyloxy-propyl, Heptyloxy-propyl, Octyloxy-propyl, Nonyloxy-propyl, 3-(3-Ethyl-hexyloxy)-propyl, 3-(2,4,4-Trimethyl-pentyloxy)-propyl, 3-(1-Ethyl-3-methyl-butoxy)-propyl;

15

In dem Umfang der vorliegenden Erfindung sind die (R)- und (S)-Isomere und die Raze-
20 zemate von Verbindungen der Formel I eingeschlossen, die chirale Zentren aufweisen.

Im Hinblick auf ihre bestimmungsgemäße Verwendung der Triazolopyrimidine der Formel I sind die folgenden Bedeutungen der Substituenten, und zwar jeweils für sich allein oder in Kombination, besonders bevorzugt:

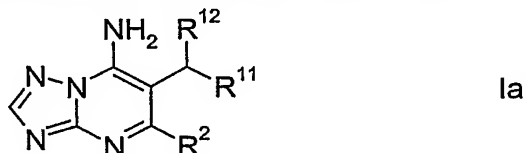
25

Verbindungen I werden bevorzugt, in denen die Gruppe R¹ maximal 9 Kohlenstoffatome aufweist.

30

Die Alkylgruppen in R¹ in Formel I stellen bevorzugt unverzweigte oder ein-, zwei- oder dreifach verzweigte Alkylgruppen dar, wobei die Alkylgruppen bevorzugt keine Substituenten trägt.

Daneben werden Verbindungen der Formel I bevorzugt, die in R¹ am α -Kohlenstoffatom eine Verzweigung aufweisen. Sie werden durch Formel Ia beschrieben:



35

in der R¹¹ C₃-C₁₀-Alkyl oder C₅-C₁₀-Alkoxyalkyl und R¹² C₁-C₄-Alkyl, insbesondere Methyl, bedeuten, wobei R¹¹ und R¹² gemeinsam nicht mehr als 12 Kohlenstoffatome aufweisen und unsubstituiert sind oder wie R¹ in Formel I substituiert sein können.

Sofern R^1 eine durch Cyano substituierte Alkylgruppe darstellt, steht die Cyanogruppe bevorzugt am endständigen Kohlenstoffatom.

- 5 In einer Ausgestaltung der erfindungsgemäßen Verbindungen I steht R^1 für C_5 - C_9 -Alkyl, C_4 - C_{11} -Alkoxy-methylen oder C_3 - C_{10} -Alkoxyethylen. Für diese Gruppen sind C_4 - C_{10} -Alkoxyketten bevorzugt.

- 10 Besonders bevorzugt sind Verbindungen I, in denen R^1 für n-Pentyl, 1-Methylbutyl, 2-Methylbutyl, 3-Methylbutyl, 2,2-Di-methylpropyl, 1-Ethylpropyl, n-Hexyl, 1,1-Dimethylpropyl, 1,2-Dimethylpropyl, 1-Methylpentyl, 2-Methylpentyl, 3-Methylpentyl, 4-Methylpentyl, 1,1-Dimethylbutyl, 1,2-Dimethylbutyl, 1,3-Dimethylbutyl, 2,2-Dimethylbutyl, 2,3-Dimethylbutyl, 3,3-Dimethylbutyl, 1-Ethylbutyl, 2-Ethylbutyl, 1,1,2-Trimethylpropyl, 1,2,2-Trimethylpropyl, 1-Ethyl-1-methylpropyl oder 1-Ethyl-2-methylpropyl steht.

- 15 Daneben sind Verbindungen der Formel I bevorzugt, in denen R^1 für n-Heptyl, 1-Methylhexyl, n-Octyl, 1-Methylheptyl, n-Nonyl, 1-Methyloctyl und 3,5,5-Trimethylhexyl steht.

- 20 In einer Ausgestaltung der erfindungsgemäßen Verbindungen I steht R^2 für n-Propyl.

- In einer weiteren Ausgestaltung der erfindungsgemäßen Verbindungen I steht R^2 für n-Butyl.

- 25 Insbesondere sind im Hinblick auf ihre Verwendung die in den folgenden Tabellen zusammengestellten Verbindungen I bevorzugt. Die in den Tabellen für einen Substituenten genannten Gruppen stellen außerdem für sich betrachtet, unabhängig von der Kombination, in der sie genannt sind, eine besonders bevorzugte Ausgestaltung des betreffenden Substituenten dar.

- 30 Tabelle 1

Verbindungen der Formel I, in denen R^1 für eine Verbindung jeweils einer Zeile der Tabelle A entspricht und R^2 n-Propyl bedeutet

Tabelle 2

- 35 Verbindungen der Formel I, in denen R^1 für eine Verbindung jeweils einer Zeile der Tabelle A entspricht und R^2 n-Butyl bedeutet

Tabelle A

Nr.	R^1
A-1	$CH_2CH_2CH_2CH_2CH_3$
A-2	$CH(CH_3)CH_2CH_2CH_3$

Nr.	R ¹
A-3	$\text{CH}_2\text{CH}(\text{CH}_3)\text{CH}_2\text{CH}_3$
A-4	$\text{CH}_2\text{CH}_2\text{CH}(\text{CH}_3)\text{CH}_3$
A-5	$\text{CH}_2\text{CH}_2\text{CH}(\text{CH}_3)_2$
A-6	$\text{CH}(\text{CH}_3)\text{CH}(\text{CH}_3)\text{CH}_3$
A-7	$\text{CH}(\text{CH}_3)\text{CH}(\text{CH}_3)_2$
A-8	$\text{CH}_2\text{C}(\text{CH}_3)_3$
A-9	$\text{CH}_2\text{CH}_2\text{CH}_2\text{CH}_2\text{CH}_2\text{CH}_3$
A-10	$\text{CH}(\text{CH}_3)\text{CH}_2\text{CH}_2\text{CH}_2\text{CH}_3$
A-11	$\text{CH}_2\text{CH}(\text{CH}_3)\text{CH}_2\text{CH}_2\text{CH}_3$
A-12	$\text{CH}_2\text{CH}_2\text{CH}(\text{CH}_3)\text{CH}_2\text{CH}_3$
A-13	$\text{CH}_2\text{CH}_2\text{CH}(\text{CH}_3)_2\text{CH}_2$
A-14	$\text{CH}_2\text{CH}_2\text{CH}_2\text{CH}(\text{CH}_3)_2$
A-15	$\text{CH}(\text{CH}_3)\text{CH}(\text{CH}_3)\text{CH}_2\text{CH}_3$
A-16	$\text{CH}(\text{CH}_3)\text{CH}_2\text{CH}(\text{CH}_3)_2$
A-17	$\text{CH}_2\text{CH}_2\text{C}(\text{CH}_3)_3$
A-18	$\text{CH}(\text{CH}_3)\text{CH}_2\text{CH}(\text{CH}_3)\text{CH}_3$
A-19	$\text{CH}_2\text{CH}_2\text{CH}_2\text{CH}_2\text{CH}_2\text{CH}_2\text{CH}_3$
A-20	$\text{CH}(\text{CH}_3)\text{CH}_2\text{CH}_2\text{CH}_2\text{CH}_2\text{CH}_3$
A-21	$\text{CH}_2\text{CH}(\text{CH}_3)\text{CH}_2\text{CH}_2\text{CH}_2\text{CH}_3$
A-22	$\text{CH}_2\text{CH}_2\text{CH}(\text{CH}_3)\text{CH}_2\text{CH}_2\text{CH}_3$
A-23	$\text{CH}_2\text{CH}_2\text{CH}_2\text{CH}(\text{CH}_3)\text{CH}_2\text{CH}_3$
A-24	$\text{CH}_2\text{CH}_2\text{CH}_2\text{CH}_2\text{CH}(\text{CH}_3)\text{CH}_3$
A-25	$\text{CH}_2\text{CH}_2\text{CH}_2\text{CH}_2\text{CH}(\text{CH}_3)_2$
A-26	$\text{CH}(\text{CH}_3)\text{CH}(\text{CH}_3)\text{CH}_2\text{CH}_2\text{CH}_3$
A-27	$\text{CH}_2\text{CH}(\text{CH}_3)\text{CH}(\text{CH}_3)\text{CH}_2\text{CH}_3$
A-28	$\text{CH}_2\text{CH}_2\text{CH}_2\text{C}(\text{CH}_3)_3$
A-29	$\text{CH}(\text{CH}_3)\text{CH}_2\text{CH}(\text{CH}_3)\text{CH}_2\text{CH}_3$
A-30	$\text{CH}_2\text{CH}(\text{CH}_3)\text{CH}(\text{CH}_3)\text{CH}_2\text{CH}_3$
A-31	$\text{CH}(\text{CH}_3)\text{CH}_2\text{CH}_2\text{CH}(\text{CH}_3)\text{CH}_3$
A-32	$\text{CH}_2\text{CH}_2\text{CH}_2\text{CH}_2\text{CH}_2\text{CH}_2\text{CH}_2\text{CH}_3$
A-33	$\text{CH}(\text{CH}_3)\text{CH}_2\text{CH}_2\text{CH}_2\text{CH}_2\text{CH}_2\text{CH}_3$
A-34	$\text{CH}_2\text{CH}(\text{CH}_3)\text{CH}_2\text{CH}_2\text{CH}_2\text{CH}_2\text{CH}_3$

Nr.	R ¹
A-35	$\text{CH}_2\text{CH}_2\text{CH}(\text{CH}_3)\text{CH}_2\text{CH}_2\text{CH}_2\text{CH}_3$
A-36	$\text{CH}_2\text{CH}_2\text{CH}_2\text{CH}(\text{CH}_3)\text{CH}_2\text{CH}_2\text{CH}_3$
A-37	$\text{CH}_2\text{CH}_2\text{CH}_2\text{CH}_2\text{CH}(\text{CH}_3)\text{CH}_2\text{CH}_3$
A-38	$\text{CH}_2\text{CH}_2\text{CH}_2\text{CH}_2\text{CH}_2\text{CH}(\text{CH}_3)_2$
A-39	$\text{CH}_2\text{CH}_2\text{CH}_2\text{CH}_2\text{C}(\text{CH}_3)_3$
A-40	$\text{CH}(\text{CH}_3)\text{CH}(\text{CH}_3)\text{CH}_2\text{CH}_2\text{CH}_2\text{CH}_3$
A-41	$\text{CH}_2\text{CH}(\text{CH}_3)\text{CH}(\text{CH}_3)\text{CH}_2\text{CH}_2\text{CH}_3$
A-42	$\text{CH}_2\text{CH}_2\text{CH}_2\text{C}(\text{CH}_3)_2\text{CH}_2\text{CH}_3$
A-43	$\text{CH}(\text{CH}_3)\text{CH}_2\text{CH}(\text{CH}_3)\text{CH}_2\text{CH}_2\text{CH}_3$
A-44	$\text{CH}_2\text{CH}(\text{CH}_3)\text{CH}(\text{CH}_3)\text{CH}_2\text{CH}_2\text{CH}_3$
A-45	$\text{CH}(\text{CH}_3)\text{CH}_2\text{CH}_2\text{CH}(\text{CH}_3)\text{CH}_2\text{CH}_3$
A-46	$\text{CH}(\text{CH}_3)\text{CH}_2\text{CH}_2\text{CH}_2\text{CH}(\text{CH}_3)_2$
A-47	$\text{CH}_2\text{CH}_2\text{CH}_2\text{CH}_2\text{CH}_2\text{CH}_2\text{CH}_2\text{CH}_3$
A-48	$\text{CH}(\text{CH}_3)\text{CH}_2\text{CH}_2\text{CH}_2\text{CH}_2\text{CH}_2\text{CH}_3$
A-49	$\text{CH}_2\text{CH}(\text{CH}_3)\text{CH}_2\text{CH}_2\text{CH}_2\text{CH}_2\text{CH}_3$
A-50	$\text{CH}_2\text{CH}_2\text{CH}(\text{CH}_3)\text{CH}_2\text{CH}_2\text{CH}_2\text{CH}_3$
A-51	$\text{CH}_2\text{CH}_2\text{CH}_2\text{CH}(\text{CH}_3)\text{CH}_2\text{CH}_2\text{CH}_3$
A-52	$\text{CH}_2\text{CH}_2\text{CH}_2\text{CH}_2\text{CH}(\text{CH}_3)\text{CH}_2\text{CH}_3$
A-53	$\text{CH}_2\text{CH}_2\text{CH}_2\text{CH}_2\text{CH}_2\text{CH}_2\text{C}(\text{CH}_3)_3$
A-54	$\text{CH}(\text{CH}_3)\text{CH}(\text{CH}_3)\text{CH}_2\text{CH}_2\text{CH}_2\text{CH}_3$
A-55	$\text{CH}_2\text{CH}(\text{CH}_3)\text{CH}(\text{CH}_3)\text{CH}_2\text{CH}_2\text{CH}_3$
A-56	$\text{CH}_2\text{CH}_2\text{CH}_2\text{C}(\text{CH}_3)_2\text{CH}_2\text{CH}_3$
A-57	$\text{CH}(\text{CH}_3)\text{CH}_2\text{CH}(\text{CH}_3)\text{CH}_2\text{CH}_2\text{CH}_3$
A-58	$\text{CH}_2\text{CH}(\text{CH}_3)\text{CH}(\text{CH}_3)\text{CH}_2\text{CH}_2\text{CH}_3$
A-59	$\text{CH}(\text{CH}_3)\text{CH}_2\text{CH}_2\text{CH}(\text{CH}_3)\text{CH}_2\text{CH}_3$
A-60	$\text{CH}(\text{CH}_3)\text{CH}_2\text{CH}_2\text{CH}_2\text{C}(\text{CH}_3)_3$
A-61	$\text{CH}_2\text{CH}(\text{CH}_3)\text{CH}_2\text{CH}_2\text{C}(\text{CH}_3)_3$
A-62	$\text{CH}_2\text{CH}_2\text{CH}(\text{CH}_3)\text{CH}_2\text{C}(\text{CH}_3)_3$
A-63	$\text{CH}(\text{CH}_3)\text{CH}_2\text{CH}_2\text{CH}_2\text{CH}_2\text{CH}(\text{CH}_3)_2$
A-64	$\text{CH}_2\text{CH}(\text{CH}_3)\text{CH}_2\text{CH}_2\text{CH}_2\text{CH}(\text{CH}_3)_2$
A-65	$\text{CH}_2\text{-O-CH}_2\text{CH}_2\text{CH}_2\text{CH}_3$
A-66	$\text{CH}_2\text{-O-CH}_2\text{CH}_2\text{CH}_2\text{CH}_2\text{CH}_3$

Nr.	R ¹
A-67	CH ₂ -O-CH ₂ CH ₂ CH ₂ CH ₂ CH ₂ CH ₃
A-68	CH ₂ -O-CH ₂ CH ₂ CH ₂ CH ₂ CH ₂ CH ₂ CH ₃
A-69	CH ₂ -O-CH ₂ CH ₂ CH ₂ CH ₂ CH ₂ CH ₂ CH ₂ CH ₃
A-70	CH ₂ -O-CH ₂ CH ₂ CH ₂ CH ₂ CH ₂ CH ₂ CH ₂ CH ₂ CH ₃
A-71	CH ₂ -O-C(CH ₃) ₃
A-72	CH ₂ -O-CH ₂ C(CH ₃) ₃
A-73	CH ₂ -O-CH(CH ₃)CH ₂ C(CH ₃) ₃
A-74	CH ₂ -O-CH(CH ₂ CH ₃)CH ₂ C(CH ₃) ₃
A-75	CH ₂ -O-CH ₂ CH(CH ₃)CH ₂ CH(CH ₃) ₂
A-76	CH ₂ -O-CH ₂ CH(CH ₂ CH ₃)CH ₂ CH ₂ CH ₃
A-77	CH ₂ -O-CH ₂ CH ₂ CH(CH ₃)CH ₂ CH(CH ₃) ₂
A-78	CH ₂ -O-CH ₂ CH ₂ CH(CH ₃)CH ₂ C(CH ₃) ₃
A-79	CH ₂ -O-CH ₂ CH ₂ CH(CH ₃)CH ₂ CH ₂ CH(CH ₃) ₂
A-80	CH ₂ -O-CH ₂ CH ₂ CH(CH ₃)CH ₂ CH ₂ CH ₂ CH(CH ₃) ₂
A-81	CH ₂ CH ₂ -O-CH ₂ CH ₂ CH ₃
A-82	CH ₂ CH ₂ -O-CH ₂ CH ₂ CH ₂ CH ₃
A-83	CH ₂ CH ₂ -O-CH ₂ CH ₂ CH ₂ CH ₂ CH ₃
A-84	CH ₂ CH ₂ -O-CH ₂ CH ₂ CH ₂ CH ₂ CH ₂ CH ₃
A-85	CH ₂ CH ₂ -O-CH ₂ CH ₂ CH ₂ CH ₂ CH ₂ CH ₂ CH ₃
A-86	CH ₂ CH ₂ -O-CH ₂ CH ₂ CH ₂ CH ₂ CH ₂ CH ₂ CH ₂ CH ₃
A-87	CH ₂ CH ₂ -O-CH(CH ₃) ₂
A-88	CH ₂ CH ₂ -O-C(CH ₃) ₃
A-89	CH ₂ CH ₂ -O-CH ₂ C(CH ₃) ₃
A-90	CH ₂ CH ₂ -O-CH(CH ₃)CH ₂ C(CH ₃) ₃
A-91	CH ₂ CH ₂ -O-CH(CH ₂ CH ₃)CH ₂ C(CH ₃) ₃
A-92	CH ₂ CH ₂ -O-CH ₂ CH(CH ₃)CH ₂ CH(CH ₃) ₂
A-93	CH ₂ CH ₂ -O-CH ₂ CH(CH ₂ CH ₃)CH ₂ CH ₂ CH ₃
A-94	CH ₂ CH ₂ -O-CH ₂ CH ₂ CH(CH ₃)CH ₂ CH(CH ₃) ₂
A-95	CH ₂ CH ₂ -O-CH ₂ CH ₂ CH(CH ₃)CH ₂ C(CH ₃) ₃
A-96	CH ₂ CH ₂ -O-CH ₂ CH ₂ CH(CH ₃)CH ₂ CH ₂ CH(CH ₃) ₂
A-97	CH ₂ CH ₂ -O-CH ₂ CH ₂ CH(CH ₃)CH ₂ CH ₂ CH ₂ CH(CH ₃) ₂

Die Verbindungen I eignen sich als Fungizide. Sie zeichnen sich aus durch eine hervorragende Wirksamkeit gegen ein breites Spektrum von pflanzenpathogenen Pilzen aus der Klasse der *Ascomyceten*, *Deuteromyceten*, *Oomyceten* und *Basidiomyceten*, insbesondere aus der Klasse der *Oomyceten*. Sie sind zum Teil systemisch wirksam und können im Pflanzenschutz als Blatt- und Bodenfungizide eingesetzt werden.

Besondere Bedeutung haben sie für die Bekämpfung einer Vielzahl von Pilzen an verschiedenen Kulturpflanzen wie Weizen, Roggen, Gerste, Hafer, Reis, Mais, Gras, Bananen, Baumwolle, Soja, Kaffee, Zuckerrohr, Wein, Obst- und Zierpflanzen und Gemüsepflanzen wie Gurken, Bohnen, Tomaten, Kartoffeln und Kürbisse, sowie an den Samen dieser Pflanzen.

Speziell eignen sie sich zur Bekämpfung folgender Pflanzenkrankheiten:

- *Alternaria*-Arten an Gemüse und Obst,
- 15 • *Bipolaris*- und *Drechslera*-Arten an Getreide, Reis und Rasen,
- *Blumeria graminis* (echter Mehltau) an Getreide,
- *Botrytis cinerea* (Grauschimmel) an Erdbeeren, Gemüse, Zierpflanzen und Reben,
- *Bremia lactucae* an Salat,
- *Erysiphe cichoracearum* und *Sphaerotheca fuliginea* an Kürbisgewächsen,
- 20 • *Fusarium*- und *Verticillium*-Arten an verschiedenen Pflanzen,
- *Mycosphaerella*-Arten an Getreide, Bananen und Erdnüssen,
- *Peronospora*-Arten an Kohl und Zwiebelgewächsen,
- *Phakopsora pachyrhizi* und *P. meibomia* an Soja,
- *Phytophthora infestans* an Kartoffeln und Tomaten,
- 25 • *Phytophthora capsici* an Paprika,
- *Plasmopara viticola* an Reben,
- *Podosphaera leucotricha* an Äpfeln,
- *Pseudocercospora herpotrichoides* an Weizen und Gerste,
- *Pseudoperonospora*-Arten an Hopfen und Gurken,
- 30 • *Puccinia*-Arten an Getreide,
- *Pyricularia oryzae* an Reis,
- *Pythium aphanidermatum* an Rasen,
- *Rhizoctonia*-Arten an Baumwolle, Reis und Rasen,
- *Septoria tritici* und *Stagonospora nodorum* an Weizen,
- 35 • *Ucinula necator* an Reben,
- *Ustilago*-Arten an Getreide und Zuckerrohr, sowie
- *Venturia*-Arten (Schorf) an Äpfeln und Birnen.

Insbesondere eignen sie sich zur Bekämpfung von Schadpilzen aus der Klasse der *Oomyceten*, wie *Peronospora*-Arten, *Phytophthora*-Arten, *Plasmopara viticola* und *Pseudoperonospora*-Arten.

- 5 Die Verbindungen I eignen sich außerdem zur Bekämpfung von Schadpilzen wie *Pae-
cilomyces variotii* im Materialschutz (z.B. Holz, Papier, Dispersionen für den Anstrich,
Fasern bzw. Gewebe) und im Vorratsschutz.

- 10 Die Verbindungen I werden angewendet, indem man die Pilze oder die vor Pilzbefall zu
schützenden Pflanzen, Saatgüter, Materialien oder den Erdboden mit einer fungizid
wirksamen Menge der Wirkstoffe behandelt. Die Anwendung kann sowohl vor als auch
nach der Infektion der Materialien, Pflanzen oder Samen durch die Pilze erfolgen.

- 15 Die fungiziden Mittel enthalten im allgemeinen zwischen 0,1 und 95, vorzugsweise zwi-
schen 0,5 und 90 Gew.-% Wirkstoff.

Die Aufwandmengen liegen bei der Anwendung im Pflanzenschutz je nach Art des
gewünschten Effektes zwischen 0,01 und 2,0 kg Wirkstoff pro ha.

- 20 Bei der Saatgutbehandlung werden im allgemeinen Wirkstoffmengen von 1 bis
1000 g/100 kg, vorzugsweise 5 bis 100 g/100 kg Saatgut benötigt.

- 25 Bei der Anwendung im Material- bzw. Vorratsschutz richtet sich die Aufwandmenge an
Wirkstoff nach der Art des Einsatzgebietes und des gewünschten Effekts. Übliche Auf-
wandmengen sind im Materialschutz beispielsweise 0,001 g bis 2 kg, vorzugsweise
0,005 g bis 1 kg Wirkstoff pro Kubikmeter behandelten Materials.

- 30 Die Verbindungen I können in die üblichen Formulierungen überführt werden, z.B. Lö-
sungen, Emulsionen, Suspensionen, Stäube, Pulver, Pasten und Granulate. Die An-
wendungsform richtet sich nach dem jeweiligen Verwendungszweck; sie soll in jedem
Fall eine feine und gleichmäßige Verteilung der erfindungsgemäßen Verbindung ge-
währleisten.

- 35 Die Formulierungen werden in bekannter Weise hergestellt, z.B. durch Verstrecken des
Wirkstoffs mit Lösungsmitteln und/oder Trägerstoffen, gewünschtenfalls unter Verwen-
dung von Emulgiermitteln und Dispergiermitteln. Als Lösungsmittel / Hilfsstoffe kom-
men dafür im wesentlichen in Betracht:

- 40 - Wasser, aromatische Lösungsmittel (z.B. Solvesso Produkte, Xylol), Paraffine (z.B.
Erdölfractionen), Alkohole (z.B. Methanol, Butanol, Pentanol, Benzylalkohol), Keto-
ne (z.B. Cyclohexanon, gamma-Butyrolacton), Pyrrolidone (NMP, NOP), Acetate

(Glykoldiacetat), Glykole, Dimethylfettsäureamide, Fettsäuren und Fettsäureester. Grundsätzlich können auch Lösungsmittelgemische verwendet werden,

- Trägerstoffe wie natürliche Gesteinsmehle (z.B. Kaoline, Tonerden, Talkum, Kreide) und synthetische Gesteinsmehle (z.B. hochdisperse Kieselsäure, Silikate); Emulgiermittel wie nichtionogene und anionische Emulgatoren (z.B. Polyoxyethylen-Fettalkohol-Ether, Alkylsulfonate und Arylsulfonate) und Dispergiermittel wie Lignin-Sulfitablaugen und Methylcellulose.

Als oberflächenaktive Stoffe kommen Alkali-, Erdalkali-, Ammoniumsalze von Ligninsulfonsäure, Naphthalinsulfonsäure, Phenolsulfonsäure, Dibutylnaphthalinsulfonsäure, Alkylarylsulfonate, Alkylsulfate, Alkylsulfonate, Fettalkoholsulfate, Fettsäuren und sulfatierte Fettalkoholglykoether zum Einsatz, ferner Kondensationsprodukte von sulfoniertem Naphthalin und Naphthalinderivaten mit Formaldehyd, Kondensationsprodukte des Naphthalins bzw. der Naphthalinsulfonsäure mit Phenol und Formaldehyd, Polyoxyethylenoctylphenolether, ethoxyliertes Isooctylphenol, Octylphenol, Nonylphenol, Alkylphenolpolyglykoether, Tributylphenylpolyglykoether, Tristerylphenylpolyglykoether, Alkylarylpolyetheralkohole, Alkohol- und Fettalkoholethylenoxid-Kondensate, ethoxyliertes Rizinusöl, Polyoxyethylenalkylether, ethoxyliertes Polyoxypropylen, Laurylalkoholpolyglykoetheracetal, Sorbitester, Ligninsulfitablaugen und Methylcellulose in Betracht.

Zur Herstellung von direkt versprühbaren Lösungen, Emulsionen, Pasten oder Öldispersionen kommen Mineralölfractionen von mittlerem bis hohem Siedepunkt, wie Kerosin oder Dieselöl, ferner Kohlenteeröle sowie Öle pflanzlichen oder tierischen Ursprungs, aliphatische, cyclische und aromatische Kohlenwasserstoffe, z.B. Toluol, Xylol, Paraffin, Tetrahydronaphthalin, alkylierte Naphthaline oder deren Derivate, Methanol, Ethanol, Propanol, Butanol, Cyclohexanol, Cyclohexanon, Isophoron, stark polare Lösungsmittel, z.B. Dimethylsulfoxid, N-Methylpyrrolidon oder Wasser in Betracht.

Pulver-, Streu- und Stäubemittel können durch Mischen oder gemeinsames Vermahlen der wirksamen Substanzen mit einem festen Trägerstoff hergestellt werden.

Granulate, z.B. Umhüllungs-, Imprägnierungs- und Homogengranulate, können durch Bindung der Wirkstoffe an feste Trägerstoffe hergestellt werden. Feste Trägerstoffe sind z.B. Mineralerden, wie Kieselgele, Silikate, Talkum, Kaolin, Attaclay, Kalkstein, Kalk, Kreide, Bolus, Löß, Ton, Dolomit, Diatomeenerde, Calcium- und Magnesiumsulfat, Magnesiumoxid, gemahlene Kunststoffe, Düngemittel, wie z.B. Ammoniumsulfat, Ammoniumphosphat, Ammoniumnitrat, Harnstoffe und pflanzliche Produkte, wie Getreidemehl, Baumrinden-, Holz- und Nußschalenmehl, Cellulosepulver und andere feste Trägerstoffe.

Die Formulierungen enthalten im allgemeinen zwischen 0,01 und 95 Gew.-%, vorzugsweise zwischen 0,1 und 90 Gew.-% des Wirkstoffs. Die Wirkstoffe werden dabei in einer Reinheit von 90% bis 100%, vorzugsweise 95% bis 100% (nach NMR-Spektrum) eingesetzt.

5

Beispiele für Formulierungen sind: 1. Produkte zur Verdünnung in Wasser

A Wasserlösliche Konzentrate (SL)

10 Gew.-Teile einer erfindungsgemäßen Verbindung werden in Wasser oder einem wasserlöslichen Lösungsmittel gelöst. Alternativ werden Netzmittel oder andere Hilfsmittel zugefügt. Bei der Verdünnung in Wasser löst sich der Wirkstoff.

B Dispergierbare Konzentrate (DC)

15 20 Gew.-Teile einer erfindungsgemäßen Verbindung werden in Cyclohexanon unter Zusatz eines Dispergiermittels z.B. Polyvinylpyrrolidon gelöst. Bei Verdünnung in Wasser ergibt sich eine Dispersion.

C Emulgierbare Konzentrate (EC)

20 15 Gew.-Teile einer erfindungsgemäßen Verbindung werden in Xylol unter Zusatz von Ca-Dodecylbenzolsulfonat und Ricinusölethoxylat (jeweils 5 %) gelöst. Bei der Verdünnung in Wasser ergibt sich eine Emulsion.

D Emulsionen (EW, EO)

25 40 Gew.-Teile einer erfindungsgemäßen Verbindung werden in Xylol unter Zusatz von Ca-Dodecylbenzolsulfonat und Ricinusölethoxylat (jeweils 5 %) gelöst. Diese Mischung wird mittels einer Emulgiermaschine (Ultraturax) in Wasser eingebracht und zu einer homogenen Emulsion gebracht. Bei der Verdünnung in Wasser ergibt sich eine Emulsion.

30 E Suspensionen (SC, OD)

20 Gew.-Teile einer erfindungsgemäßen Verbindung werden unter Zusatz von Dispergier- und Netzmitteln und Wasser oder einem organischen Lösungsmittel in einer Rührwerkskugelmühle zu einer feinen Wirkstoffsuspension zerkleinert. Bei der Verdünnung in Wasser ergibt sich eine stabile Suspension des Wirkstoffs.

35

F Wasserdispergierbare und wasserlösliche Granulate (WG, SG)

40 50 Gew.-Teile einer erfindungsgemäßen Verbindung werden unter Zusatz von Dispergier- und Netzmitteln fein gemahlen und mittels technischer Geräte (z.B. Extrusion, Sprühturm, Wirbelschicht) als wasserdispergierbare oder wasserlösliche Granulate hergestellt. Bei der Verdünnung in Wasser ergibt sich eine stabile Dispersion oder Lösung des Wirkstoffs.

G Wasserdispersierbare und wasserlösliche Pulver (WP, SP)

75 Gew.-Teile einer erfindungsgemäßen Verbindung werden unter Zusatz von Dispergier- und Netzmitteln sowie Kieselsäuregel in einer Rotor-Strator Mühle vermahlen. Bei der Verdünnung in Wasser ergibt sich eine stabile Dispersion oder Lösung des Wirkstoffs.

2. Produkte für die Direktapplikation

H Stäube (DP)

10 5 Gew.Teile einer erfindungsgemäßen Verbindung werden fein gemahlen und mit 95 % feinteiligem Kaolin innig vermischt. Man erhält dadurch ein Stäubemittel.

I Granulate (GR, FG, GG, MG)

15 0.5 Gew-Teile einer erfindungsgemäßen Verbindung werden fein gemahlen und mit 95.5 % Trägerstoffe verbunden. Gängige Verfahren sind dabei die Extrusion, die Sprühtrocknung oder die Wirbelschicht. Man erhält dadurch ein Granulat für die Direktapplikation.

J ULV- Lösungen (UL)

20 10 Gew.-Teile einer erfindungsgemäßen Verbindung werden in einem organischen Lösungsmittel z.B. Xylol gelöst. Dadurch erhält man ein Produkt für die Direktapplikation.

25 Die Wirkstoffe können als solche, in Form ihrer Formulierungen oder den daraus bereiteten Anwendungsformen, z.B. in Form von direkt versprühbaren Lösungen, Pulvern, Suspensionen oder Dispersionen, Emulsionen, Öldispersionen, Pasten, Stäubemitteln, Streumitteln, Granulaten durch Versprühen, Vernebeln, Verstäuben, Verstreuen oder Gießen angewendet werden. Die Anwendungsformen richten sich ganz nach den Verwendungszwecken; sie sollten in jedem Fall möglichst die feinste Verteilung der erfindungsgemäßen Wirkstoffe gewährleisten.

35 Wässrige Anwendungsformen können aus Emulsionskonzentraten, Pasten oder netzbaren Pulvern (Spritzpulver, Öldispersionen) durch Zusatz von Wasser bereiteten werden. Zur Herstellung von Emulsionen, Pasten oder Öldispersionen können die Substanzen als solche oder in einem Öl oder Lösungsmittel gelöst, mittels Netz-, Haft-, Dispergier- oder Emulgiermittel in Wasser homogenisiert werden. Es können aber auch aus wirksamer Substanz Netz-, Haft-, Dispergier- oder Emulgiermittel und eventuell Lösungsmittel oder Öl bestehende Konzentrate hergestellt werden, die zur Verdünnung mit Wasser geeignet sind.

Die Wirkstoffkonzentrationen in den anwendungsfertigen Zubereitungen können in größeren Bereichen variiert werden. Im allgemeinen liegen sie zwischen 0,0001 und 10%, vorzugsweise zwischen 0,01 und 1%.

- 5 Die Wirkstoffe können auch mit gutem Erfolg im Ultra-Low-Volume-Verfahren (ULV) verwendet werden, wobei es möglich ist, Formulierungen mit mehr als 95 Gew.-% Wirkstoff oder sogar den Wirkstoff ohne Zusätze auszubringen.

- 10 Zu den Wirkstoffen können Öle verschiedenen Typs, Netzmittel, Adjuvants, Herbizide, Fungizide, andere Schädlingsbekämpfungsmittel, Bakterizide, gegebenenfalls auch erst unmittelbar vor der Anwendung (Tankmix), zugesetzt werden. Diese Mittel können zu den erfindungsgemäßen Mitteln im Gewichtsverhältnis 1:10 bis 10:1 zugemischt werden.

- 15 Die erfindungsgemäßen Mittel können in der Anwendungsform als Fungizide auch zusammen mit anderen Wirkstoffen vorliegen, der z.B. mit Herbiziden, Insektiziden, Wachstumsregulatoren, Fungiziden oder auch mit Düngemitteln. Beim Vermischen der Verbindungen I bzw. der sie enthaltenden Mittel in der Anwendungsform als Fungizide mit anderen Fungiziden erhält man in vielen Fällen eine Vergrößerung des fungiziden
20 Wirkungsspektrums.

Die folgende Liste von Fungiziden, mit denen die erfindungsgemäßen Verbindungen gemeinsam angewendet werden können, soll die Kombinationsmöglichkeiten erläutern, nicht aber einschränken:

25

- Acylalanine wie Benalaxyl, Metalaxyl, Ofurace, Oxadixyl,
- Aminderivate wie Aldimorph, Dodine, Dodemorph, Fenpropimorph, Fenpropidin, Guazatine, Iminoctadine, Spiroxamin, Tridemorph
- Anilinopyrimidine wie Pyrimethanil, Mepanipyrim oder Cyprodinil,
- 30 • Antibiotika wie Cycloheximid, Griseofulvin, Kasugamycin, Natamycin, Polyoxin oder Streptomycin,
- Azole wie Bitertanol, Bromoconazol, Cyproconazol, Difenconazole, Dinitroconazol, Enilconazol, Epoxiconazol, Fenbuconazol, Fluquiconazol, Flusilazol, Flutriafol, Hexaconazol, Imazalil, Ipconazol, Metconazol, Myclobutanil, Penconazol, Propiconazol, Prochloraz, Prothioconazol, Simeconazol, Tebuconazol, Tetraconazol, Triadimefon, Triadimenol, Triflumizol, Triticonazol,
- 35 • Dicarboximide wie Iprodion, Myclobutol, Procymidon, Vinclozolin,
- Dithiocarbamate wie Ferbam, Nabam, Maneb, Mancozeb, Metam, Metiram, Propineb, Polycarbamat, Thiram, Ziram, Zineb,
- 40 • Heterocyclische Verbindungen wie Anilazin, Benomyl, Boscalid, Carbendazim, Carboxin, Oxycarboxin, Cyazofamid, Dazomet, Dithianon, Famoxadon, Fenamidon,

Fenarimol, Fuberidazol, Flutolanil, Furametpyr, Isoprothiolan, Mepronil, Nuarimol, Picobenzamid, Probenazol, Proquinazid, Pyrifenox, Pyroquilon, Quinoxifen, Silthiofam, Thiabendazol, Thifluzamid, Thiophanat-methyl, Tiadinil, Tricyclazol, Triforine,

- Kupferfungizide wie Bordeaux Brühe, Kupferacetat, Kupferoxychlorid, basisches Kupfersulfat,
- Nitrophenylderivate, wie Binapacryl, Dinocap, Dinobuton, Nitrophthal-isopropyl
- Phenylpyrrole wie Fenpiclonil oder Fludioxonil,
- Schwefel,
- Sonstige Fungizide wie Acibenzolar-S-methyl, Benthiavalicarb, Carpropamid, Chlorothalonil, Cyflufenamid, Cymoxanil, Diclomezin, Diclocymet, Diethofencarb, Edifenphos, Ethaboxam, Fenhexamid, Fentin-Acetate, Fenoxanil, Ferimzone, Fluazinam, Phosphorige Säure, Fosetyl, Fosetyl-Aluminium, Iprovalicarb, Hexachlorbenzol, Metrafenon, Pencycuron, Propamocarb, Phthalid, Toloclofos-methyl, Quintozenone, Zoxamid,
- Strobilurine wie Azoxystrobin, Dimoxystrobin, Enestroburin, Fluoxastrobin, Kresoxim-methyl, Metominostrobin, Orysastrobin, Picoxystrobin, Pyraclostrobin oder Trifloxystrobin,
- Sulfensäurederivate wie Captafol, Captan, Dichlofluanid, Folpet, Tolyfluanid
- Zimtsäureamide und Analoge wie Dimethomorph, Flumetover oder Flumorph.

Synthesebeispiele

Die in den nachstehenden Synthesebeispielen wiedergegebenen Vorschriften wurden unter entsprechender Abwandlung der Ausgangsverbindungen zur Gewinnung weiterer Verbindungen I benutzt. Die so erhaltenen Verbindungen sind in der anschließenden Tabelle mit physikalischen Angaben aufgeführt.

Beispiel 1: Herstellung von 5-Cyano-dodecan-4-on

Eine Lösung von 0,45 mol Decanitril in 300 ml Tetrahydrofuran (THF) wurde bei -70°C mit einer Lösung von 0,495 mol Butyllithium in Hexan versetzt, dann etwa drei Std. bei dieser Temperatur gerührt und 0,45 mol Ethyl Butanoat zugesetzt. Anschließend wurde noch etwa 16 Std. bei $20 - 25^{\circ}\text{C}$ gerührt, dann wurden 200 ml Wasser zugesetzt und mit verd. HCL-Lösung angesäuert. Nach Phasentrennung wurde die organische Phase abgetrennt, mit Wasser gewaschen, getrocknet und vom Lösungsmittel befreit. Es blieben 71 g der Titelverbindung zurück.

Beispiel 2: Herstellung von 7-Amino-5-n-propyl-6-octyl-[1,2,4]-triazolo[1,5-a]-pyrimidin

Eine Mischung von je 1,27 mol 5-Cyano-dodecan-3-on aus Beispiel 1, 3-Amino-1,2,4-triazol und 0,25 mol p-Toluolsulfonsäure in 900 ml Mesitylen wurde etwa 4 Std. auf 170°C erhitzt. Nach Abkühlen auf etwa $20 - 25^{\circ}\text{C}$ wurde der Niederschlag abfiltriert,

der dann in Dichlormethan aufgenommen wurde. Aus der Lösung wurde nach Waschen mit Wasser und Trocknen das Lösungsmittel abdestilliert, als Rückstand blieben 102 g der Titelverbindung vom Fp. 165°C zurück.

5 Tabelle I – Verbindungen der Formel I

Nr.	R ¹	R ²	Phys. Daten (Fp. [°C])
I-1	CH(CH ₃)(CH ₂) ₅ CH ₃	CH ₂ CH ₂ CH ₃	145
I-2	(CH ₂) ₇ CH ₃	CH ₂ CH ₂ CH ₃	165
I-3	CH(CH ₃)(CH ₂) ₅ CH ₃	CH ₂ CH ₂ CH ₂ CH ₃	116
I-4	(CH ₂) ₇ CH ₃	CH ₂ CH ₂ CH ₂ CH ₃	145
I-5	(CH ₂) ₂ CH(CH ₃)CH ₂ C(CH ₃) ₃	CH ₂ CH ₂ CH ₃	185
I-6	(CH ₂) ₅ CH ₃	CH ₂ CH ₂ CH ₃	174-175
I-7	(CH ₂) ₆ CH ₃	CH ₂ CH ₂ CH ₃	169-170
I-8	(CH ₂) ₁₀ CH ₃	CH ₂ CH ₂ CH ₃	138-139
I-9	(CH ₂) ₅ CN	CH ₂ CH ₂ CH ₃	158

Beispiele für die Wirkung gegen Schadpilze

Die fungizide Wirkung der Verbindungen der Formel I ließ sich durch die folgenden
10 Versuche zeigen:

Die Wirkstoffe wurden als eine Stammlösung aufbereitet mit 25 mg Wirkstoff, welcher mit einem Gemisch aus Aceton und/oder DMSO und dem Emulgator Uniperol® EL (Netzmittel mit Emulgier- und Dispergierwirkung auf der Basis ethoxylierter Alkylpheno-
15 le) im Volumen-Verhältnis Lösungsmittel-Emulgator von 99 zu 1 ad 10 ml aufgefüllt wurde. Anschließend wurde ad 100 ml mit Wasser aufgefüllt. Diese Stammlösung wurde mit dem beschriebenen Lösungsmittel-Emulgator-Wasser Gemisch zu der unten angegebenen Wirkstoffkonzentration verdünnt.

20 Beispiel 1 - Wirksamkeit gegen Rebenperonospora verursacht durch *Plasmopara viticola*

Blätter von Topfreben wurden mit wässriger Suspension in der unten angegebenen Wirkstoffkonzentration bis zur Tropfnässe besprüht. Am folgenden Tag wurden die Unterseiten der Blätter mit einer wässrigen Sporangienaufschwemmung von *Plasmopara viticola* inokuliert. Danach wurden die Reben zunächst für 48 Stunden in einer wasserdampfgesättigten Kammer bei 24°C und anschließend für 5 Tage im Gewächshaus bei Temperaturen zwischen 20 und 30°C aufgestellt. Nach dieser Zeit wurden die Pflanzen zur Beschleunigung des Sporangienträgerausbruchs abermals für 16 Stunden in eine
25

feuchte Kammer gestellt. Dann wurde das Ausmaß der Befallsentwicklung auf den Blattunterseiten visuell ermittelt.

5 In diesem Test zeigten die mit 250 ppm der Verbindungen I-1, I-2, I-3, I-4, I-6, bzw. I-7 behandelten Pflanzen nicht über 10 % Befall, während die unbehandelten Pflanzen zu 90% befallen waren.

Beispiel 2: Aktivität gegen die Krautfäule an Tomaten verursacht durch *Phytophthora infestans* bei protektiver Behandlung

10

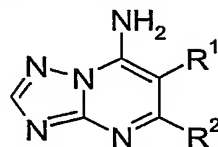
Blätter von getopften Tomatenpflanzen wurden mit einer wässrigen Suspension in der unten angegebenen Wirkstoffkonzentration bis zur Tropfnässe besprüht. Am folgenden Tag wurden die Blätter mit einer wässrigen Sporangienaufschwemmung von *Phytophthora infestans* infiziert. Anschließend wurden die Pflanzen in einer wasserdampf-
15 gesättigten Kammer bei Temperaturen zwischen 18 und 20°C aufgestellt. Nach 6 Tagen hatte sich die Krautfäule auf den unbehandelten, jedoch infizierten Kontrollpflanzen so stark entwickelt, dass der Befall visuell in % ermittelt werden konnte.

20

In diesem Test zeigten die mit 250 ppm der Verbindungen I-1, I-2, I-5, I-6, bzw. I-7 behandelten Pflanzen maximal 3 % Befall, während die unbehandelten Pflanzen zu 95% befallen waren.

Patentansprüche

1. Triazolopyrimidine der Formel I



I

5 in der die Substituenten folgende Bedeutung haben:

R^1 C₅-C₉-Alkyl, C₄-C₁₁-Alkoxy-methylen oder C₃-C₁₀-Alkoxy-ethylen, wobei die aliphatischen Gruppen durch eine bis drei der folgenden Gruppen substituiert sein können:

10

Cyano, Nitro, Hydroxy, C₃-C₆-Cycloalkyl, C₁-C₆-Alkylthio, C₅-C₁₂-Alkynyl oder NR^aR^b;

R^a, R^b Wasserstoff oder C₁-C₆-Alkyl;

15

R^2 n-Propyl oder n-Butyl.

2. Verbindungen der Formel I gemäß Anspruch 1, worin R^1 für eine unsubstituierte unverzweigte oder ein-, zwei- oder dreifach verzweigte Alkylkette mit bis zu 9 Kohlenstoffatomen steht.

20

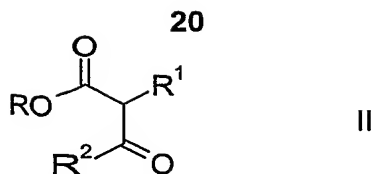
3. Verbindungen der Formel I gemäß Anspruch 1 oder 2, worin R^2 für n-Propyl steht.

25 4. Verbindungen der Formel I gemäß Anspruch 1 oder 2, worin R^2 für n-Butyl steht.

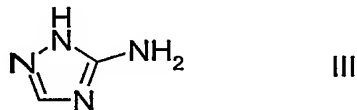
5. 6-(1-Methyl-heptyl)-5-propyl-[1,2,4]triazolo[1,5-a]pyrimidin-7-ylamin;
 6-Octyl-5-propyl-[1,2,4]triazolo[1,5-a]pyrimidin-7-ylamin;
 5-Butyl-6-(1-methyl-heptyl)-[1,2,4]triazolo[1,5-a]pyrimidin-7-ylamin;
 30 5-Butyl-6-octyl-[1,2,4]triazolo[1,5-a]pyrimidin-7-ylamin;
 5-Propyl-6-(3,5,5-trimethyl-hexyl)-[1,2,4]triazolo[1,5-a]pyrimidin-7-ylamin;
 6-Hexyl-5-propyl-[1,2,4]triazolo[1,5-a]pyrimidin-7-ylamin;
 6-Heptyl-5-propyl-[1,2,4]triazolo[1,5-a]pyrimidin-7-ylamin;
 5-Propyl-6-undecyl-[1,2,4]triazolo[1,5-a]pyrimidin-7-ylamin.

35

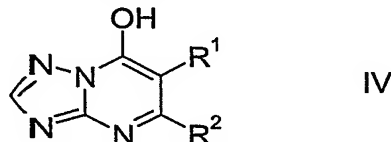
6. Verfahren zur Herstellung von Verbindungen der Formel I gemäß einem der Ansprüche 1 bis 5, dadurch gekennzeichnet, dass man β -Ketoester der Formel II,



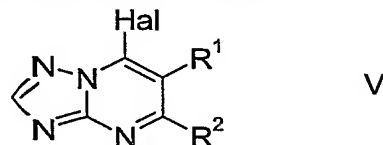
in der R für C₁-C₄-Alkyl steht, mit 3-Amino-1,2,4-triazol der Formel III



zu 7-Hydroxytriazolopyrimidinen der Formel IV

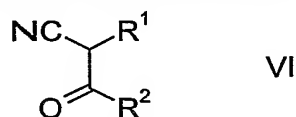


umsetzt, welche zu Verbindungen der Formel V,



in der Hal für Chlor oder Brom steht, halogeniert werden, und V mit Ammoniak umgesetzt wird.

7. Verfahren zur Herstellung von Verbindungen der Formel I gemäß einem der Ansprüche 1 bis 5, dadurch gekennzeichnet, dass man Acylcyanide der Formel VI,



mit 3-Amino-1,2,4-triazol der Formel III gemäß Anspruch 6 umsetzt.

8. Fungizides Mittel, enthaltend einen festen oder flüssigen Träger und eine Verbindung der Formel I gemäß einem der Ansprüche 1 bis 5.
9. Saatgut, enthaltend eine Verbindung der Formel I gemäß einem der Ansprüche 1 bis 5 in Mengen von 1 bis 1000 g pro 100 kg.
10. Verfahren zur Bekämpfung von pflanzenpathogenen Schadpilzen, dadurch gekennzeichnet, dass man die Pilze, oder die vor Pilzbefall zu schützenden Materialien, Pflanzen, den Boden oder Saatgüter mit einer wirksamen Menge einer Verbindung der Formel I gemäß einem der Ansprüche 1 bis 5 behandelt.

INTERNATIONAL SEARCH REPORT

International Application No
PCT/EP2005/002426

A. CLASSIFICATION OF SUBJECT MATTER

IPC 7 C07D487/04 A01N43/90
//(C07D487/04,249:00,239:00)

According to International Patent Classification (IPC) or to both national classification and IPC

B. FIELDS SEARCHED

Minimum documentation searched (classification system followed by classification symbols)

IPC 7 C07D A01N

Documentation searched other than minimum documentation to the extent that such documents are included in the fields searched

Electronic data base consulted during the international search (name of data base and, where practical, search terms used)

EPO-Internal, CHEM ABS Data

C. DOCUMENTS CONSIDERED TO BE RELEVANT

Category *	Citation of document, with indication, where appropriate, of the relevant passages	Relevant to claim No.
X	EP 0 141 317 A (BASF AKTIENGESELLSCHAFT) 15 May 1985 (1985-05-15) cited in the application Seiten 9, 10, Verbindungen Nr. 16, 21, 23, 24, 42, 48; claims -----	1-10
A	WO 03/009687 A (BASF AKTIENGESELLSCHAFT; TORMO I BLASCO, JORDI; SAUTER, HUBERT; MUELLE) 6 February 2003 (2003-02-06) claims; examples 7-9 -----	1-10
A	EP 0 215 382 A (BASF AKTIENGESELLSCHAFT) 25 March 1987 (1987-03-25) claims; tables 1a,2,3 ----- -/-	1-5,8-10

☒ Further documents are listed in the continuation of box C.

☒ Patent family members are listed in annex.

* Special categories of cited documents :

"A" document defining the general state of the art which is not considered to be of particular relevance

"E" earlier document but published on or after the international filing date

"L" document which may throw doubts on priority claim(s) or which is cited to establish the publication date of another citation or other special reason (as specified)

"O" document referring to an oral disclosure, use, exhibition or other means

"P" document published prior to the international filing date but later than the priority date claimed

"T" later document published after the international filing date or priority date and not in conflict with the application but cited to understand the principle or theory underlying the invention

"X" document of particular relevance; the claimed invention cannot be considered novel or cannot be considered to involve an inventive step when the document is taken alone

"Y" document of particular relevance; the claimed invention cannot be considered to involve an inventive step when the document is combined with one or more other such documents, such combination being obvious to a person skilled in the art.

"&" document member of the same patent family

Date of the actual completion of the international search

8 June 2005

Date of mailing of the international search report

16/06/2005

Name and mailing address of the ISA

European Patent Office, P.B. 5818 Patentlaan 2
NL - 2280 HV Rijswijk
Tel. (+31-70) 340-2040, Tx. 31 651 epo nl,
Fax: (+31-70) 340-3016

Authorized officer

Hass, C

INTERNATIONAL SEARCH REPORT

International Application No
PCT/EP2005/002426

C.(Continuation) DOCUMENTS CONSIDERED TO BE RELEVANT		
Category *	Citation of document, with indication, where appropriate, of the relevant passages	Relevant to claim No.
A	GB 1 148 629 A (VEB. DEUTSCHES HYDRIERWERK RODLEBEN) 16 April 1969 (1969-04-16) cited in the application page 1, line 10 - line 23 -----	1
A	EP 0 770 615 A (AMERICAN CYANAMID COMPANY; BASF AKTIENGESELLSCHAFT) 2 May 1997 (1997-05-02) cited in the application claim 1 -----	6

INTERNATIONAL SEARCH REPORT

Information on patent family members

International Application No

PCT/EP2005/002426

Patent document cited in search report		Publication date	Patent family member(s)	Publication date
EP 0141317	A	15-05-1985	DE 3338292 A1	02-05-1985
			AT 32077 T	15-02-1988
			AU 566960 B2	05-11-1987
			AU 3452684 A	26-04-1985
			CA 1242715 A1	04-10-1988
			CS 248724 B2	12-02-1987
			DD 232635 A5	05-02-1986
			DE 3468878 D1	25-02-1988
			EP 0141317 A2	15-05-1985
			HU 36328 A2	30-09-1985
			IL 73258 A	30-11-1987
			JP 60104089 A	08-06-1985
			NZ 209936 A	31-03-1987
			PL 250093 A2	16-07-1985
			US RE32676 E	24-05-1988
			US 4617303 A	14-10-1986
WO 03009687	A	06-02-2003	BR 0211427 A	13-07-2004
			CA 2454542 A1	06-02-2003
			CN 1535113 A	06-10-2004
			WO 03009687 A1	06-02-2003
			EP 1414302 A1	06-05-2004
			HU 0401488 A2	28-12-2004
			JP 2004535472 T	25-11-2004
			MX PA04000403 A	18-03-2004
EP 0215382	A	25-03-1987	DE 3533050 A1	26-03-1987
			AT 55131 T	15-08-1990
			AU 583150 B2	20-04-1989
			AU 6271986 A	19-03-1987
			CA 1288096 C	27-08-1991
			CS 264282 B2	13-06-1989
			DD 249624 A5	16-09-1987
			DE 3673101 D1	06-09-1990
			EP 0215382 A1	25-03-1987
			HU 42289 A2	28-07-1987
			JP 62067084 A	26-03-1987
			NZ 217593 A	28-10-1988
			PL 261406 A2	31-03-1988
			ZA 8607018 A	27-05-1987
GB 1148629	A	16-04-1969	DE 1620694 A1	03-12-1970
			DE 1792811 C2	30-12-1982
EP 0770615	A	02-05-1997	AT 243211 T	15-07-2003
			BR 9605258 A	21-07-1998
			CA 2188905 A1	28-04-1997
			DE 69628712 D1	24-07-2003
			DE 69628712 T2	29-04-2004
			DK 770615 T3	14-07-2003
			EP 0770615 A1	02-05-1997
			ES 2202419 T3	01-04-2004
			HU 9602957 A2	30-06-1997
			IL 119496 A	24-07-2001
			JP 9124651 A	13-05-1997
			PT 770615 T	31-10-2003
			RU 2147584 C1	20-04-2000
			SG 55239 A1	21-12-1998

INTERNATIONAL SEARCH REPORT

Information on patent family members

International Application No
PCT/EP2005/002426

Patent document cited in search report	Publication date	Patent family member(s)	Publication date
EP 0770615	A	SI 770615 T1	31-12-2003
		SK 137796 A3	07-05-1997
		TR 970386 A2	21-05-1997
		US 5808066 A	15-09-1998
		ZA 9608957 A	24-04-1998
<hr/>			

INTERNATIONALER RECHERCHENBERICHT

Internationales Aktenzeichen

PCT/EP2005/002426

A. KLASSIFIZIERUNG DES ANMELDUNGSGEGENSTANDES IPK 7 C07D487/04 A01N43/90 //(C07D487/04, 249:00, 239:00)		
Nach der Internationalen Patentklassifikation (IPK) oder nach der nationalen Klassifikation und der IPK		
B. RECHERCHIERTE GEBIETE Recherchierte Mindestprüfstoff (Klassifikationssystem und Klassifikationssymbole) IPK 7 C07D A01N		
Recherchierte aber nicht zum Mindestprüfstoff gehörende Veröffentlichungen, soweit diese unter die recherchierten Gebiete fallen		
Während der internationalen Recherche konsultierte elektronische Datenbank (Name der Datenbank und evtl. verwendete Suchbegriffe) EPO-Internal, CHEM ABS Data		
C. ALS WESENTLICH ANGESEHENE UNTERLAGEN		
Kategorie*	Bezeichnung der Veröffentlichung, soweit erforderlich unter Angabe der in Betracht kommenden Teile	Betr. Anspruch Nr.
X	EP 0 141 317 A (BASF AKTIENGESELLSCHAFT) 15. Mai 1985 (1985-05-15) in der Anmeldung erwähnt Seiten 9, 10, Verbindungen Nr. 16, 21, 23, 24, 42, 48; Ansprüche	1-10
A	WO 03/009687 A (BASF AKTIENGESELLSCHAFT; TORMO I BLASCO, JORDI; SAUTER, HUBERT; MUELLE) 6. Februar 2003 (2003-02-06) Ansprüche; Beispiele 7-9	1-10
A	EP 0 215 382 A (BASF AKTIENGESELLSCHAFT) 25. März 1987 (1987-03-25) Ansprüche; Tabellen 1a, 2, 3	1-5, 8-10
-/-		
<input checked="" type="checkbox"/> Weitere Veröffentlichungen sind der Fortsetzung von Feld C zu entnehmen <input checked="" type="checkbox"/> Siehe Anhang Patentfamilie		
* Besondere Kategorien von angegebenen Veröffentlichungen : "A" Veröffentlichung, die den allgemeinen Stand der Technik definiert, aber nicht als besonders bedeutsam anzusehen ist "E" älteres Dokument, das jedoch erst am oder nach dem internationalen Anmeldedatum veröffentlicht worden ist "L" Veröffentlichung, die geeignet ist, einen Prioritätsanspruch zweifelhaft erscheinen zu lassen, oder durch die das Veröffentlichungsdatum einer anderen im Recherchenbericht genannten Veröffentlichung belegt werden soll oder die aus einem anderen besonderen Grund angegeben ist (wie ausgeführt) "O" Veröffentlichung, die sich auf eine mündliche Offenbarung, eine Benutzung, eine Ausstellung oder andere Maßnahmen bezieht "P" Veröffentlichung, die vor dem internationalen Anmeldedatum, aber nach dem beanspruchten Prioritätsdatum veröffentlicht worden ist "T" Spätere Veröffentlichung, die nach dem internationalen Anmeldedatum oder dem Prioritätsdatum veröffentlicht worden ist und mit der Anmeldung nicht kollidiert, sondern nur zum Verständnis des der Erfindung zugrundeliegenden Prinzips oder der ihr zugrundeliegenden Theorie angegeben ist "X" Veröffentlichung von besonderer Bedeutung; die beanspruchte Erfindung kann allein aufgrund dieser Veröffentlichung nicht als neu oder auf erfinderischer Tätigkeit beruhend betrachtet werden "Y" Veröffentlichung von besonderer Bedeutung; die beanspruchte Erfindung kann nicht als auf erfinderischer Tätigkeit beruhend betrachtet werden, wenn die Veröffentlichung mit einer oder mehreren anderen Veröffentlichungen dieser Kategorie in Verbindung gebracht wird und diese Verbindung für einen Fachmann naheliegend ist "&" Veröffentlichung, die Mitglied derselben Patentfamilie ist		
Datum des Abschlusses der internationalen Recherche 8. Juni 2005		Absendedatum des internationalen Recherchenberichts 16/06/2005
Name und Postanschrift der Internationalen Recherchenbehörde Europäisches Patentamt, P.B. 5918 Patentlaan 2 NL - 2280 HV Rijswijk Tel. (+31-70) 340-2040, Tx. 31 651 epo nl, Fax: (+31-70) 340-3016		Bevollmächtigter Beauftragter Hass, C

INTERNATIONALER RECHERCHENBERICHT

Internationales Aktenzeichen

PCT/EP2005/002426

C.(Fortsetzung) ALS WESENTLICH ANGESEHENE UNTERLAGEN

Kategorie°	Bezeichnung der Veröffentlichung, soweit erforderlich unter Angabe der in Betracht kommenden Teile	Betr. Anspruch Nr.
A	GB 1 148 629 A (VEB. DEUTSCHES HYDRIERWERK RODLER) 16. April 1969 (1969-04-16) in der Anmeldung erwähnt Seite 1, Zeile 10 - Zeile 23 -----	1
A	EP 0 770 615 A (AMERICAN CYANAMID COMPANY; BASF AKTIENGESELLSCHAFT) 2. Mai 1997 (1997-05-02) in der Anmeldung erwähnt Anspruch 1 -----	6

INTERNATIONALE RECHERCHENBERICHT

Angaben zu Veröffentlichungen, die zur selben Patentfamilie gehören

Internationales Aktenzeichen

PCT/EP2005/002426

Im Recherchenbericht angeführtes Patentdokument		Datum der Veröffentlichung	Mitglied(er) der Patentfamilie	Datum der Veröffentlichung
EP 0141317	A	15-05-1985	DE 3338292 A1	02-05-1985
			AT 32077 T	15-02-1988
			AU 566960 B2	05-11-1987
			AU 3452684 A	26-04-1985
			CA 1242715 A1	04-10-1988
			CS 248724 B2	12-02-1987
			DD 232635 A5	05-02-1986
			DE 3468878 D1	25-02-1988
			EP 0141317 A2	15-05-1985
			HU 36328 A2	30-09-1985
			IL 73258 A	30-11-1987
			JP 60104089 A	08-06-1985
			NZ 209936 A	31-03-1987
			PL 250093 A2	16-07-1985
			US RE32676 E	24-05-1988
			US 4617303 A	14-10-1986
WO 03009687	A	06-02-2003	BR 0211427 A	13-07-2004
			CA 2454542 A1	06-02-2003
			CN 1535113 A	06-10-2004
			WO 03009687 A1	06-02-2003
			EP 1414302 A1	06-05-2004
			HU 0401488 A2	28-12-2004
			JP 2004535472 T	25-11-2004
			MX PA04000403 A	18-03-2004
EP 0215382	A	25-03-1987	DE 3533050 A1	26-03-1987
			AT 55131 T	15-08-1990
			AU 583150 B2	20-04-1989
			AU 6271986 A	19-03-1987
			CA 1288096 C	27-08-1991
			CS 264282 B2	13-06-1989
			DD 249624 A5	16-09-1987
			DE 3673101 D1	06-09-1990
			EP 0215382 A1	25-03-1987
			HU 42289 A2	28-07-1987
			JP 62067084 A	26-03-1987
			NZ 217593 A	28-10-1988
			PL 261406 A2	31-03-1988
			ZA 8607018 A	27-05-1987
GB 1148629	A	16-04-1969	DE 1620694 A1	03-12-1970
			DE 1792811 C2	30-12-1982
EP 0770615	A	02-05-1997	AT 243211 T	15-07-2003
			BR 9605258 A	21-07-1998
			CA 2188905 A1	28-04-1997
			DE 69628712 D1	24-07-2003
			DE 69628712 T2	29-04-2004
			DK 770615 T3	14-07-2003
			EP 0770615 A1	02-05-1997
			ES 2202419 T3	01-04-2004
			HU 9602957 A2	30-06-1997
			IL 119496 A	24-07-2001
			JP 9124651 A	13-05-1997
			PT 770615 T	31-10-2003
			RU 2147584 C1	20-04-2000
			SG 55239 A1	21-12-1998

INTERNATIONALER RECHERCHENBERICHT

Angaben zu Veröffentlichungen, die zur selben Patentfamilie gehören

Internationales Aktenzeichen

PCT/EP2005/002426

Im Recherchenbericht angeführtes Patentdokument	Datum der Veröffentlichung	Mitglied(er) der Patentfamilie	Datum der Veröffentlichung
EP 0770615 A		SI 770615 T1	31-12-2003
		SK 137796 A3	07-05-1997
		TR 970386 A2	21-05-1997
		US 5808066 A	15-09-1998
		ZA 9608957 A	24-04-1998
<hr/>			